(19) OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) Número de publicación: **2 220 100**

(51) Int. Cl.[7]: **A61K 7/16**

(12) TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA T3

(86) Número de solicitud europea: **99938351 .6**
(86) Fecha de presentación: **23.07.1999**
(87) Número de publicación de la solicitud: **1107725**
(87) Fecha de publicación de la solicitud: **20.06.2001**

(54) Título: **Pasta de dientes que comprende carbonato cálcico fino y grueso.**

(30) Prioridad: **24.08.1998 EP 98306759**

(45) Fecha de publicación de la mención BOPI:
01.12.2004

(45) Fecha de la publicación del folleto de la patente:
01.12.2004

(73) Titular/es: **UNILEVER N.V.**
Weena 455
3013 AL Rotterdam, NL

(72) Inventor/es: **Ashcroft, Alexander, Thomas;**
Gibbs, Christopher, David;
Waterfield, Philip, Christopher y
Singleton, Stephen, John

(74) Agente: **Carpintero López, Francisco**

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

Venta de fascículos: Oficina Española de Patentes y Marcas. C/Panamá, 1 – 28036 Madrid

DESCRIPCIÓN

Pasta de dientes que comprende carbonato cálcico fino y grueso.

La presente invención trata de una pasta de dientes que contiene, en un medio líquido o pastoso adecuado, carbonato cálcico particulado como principal agente limpiador abrasivo.

El carbonato cálcico particulado es un agente limpiador abrasivo muy conocido de las pastas de dientes, y las pastas de dientes con este agente limpiador abrasivo han estado en el mercado durante décadas. Se han usado o sugerido varios tipos y fuentes de carbonato cálcico particulado, tales como carbonatos cálcicos naturales particulados, algunos ejemplos de los cuales son piedra caliza pulverizada, mármol molido, tierra caliza, tierra de vaterita, tierra de aragonito y cal preparada, así como carbonatos cálcicos particulados sintéticos, tales como carbonatos cálcicos precipitados. Los carbonatos cálcicos particulados sintéticos se usan con más frecuencia y, generalmente, se prefieren en lugar de carbonatos cálcicos naturales particulados. El tamaño medio de partícula de los diversos carbonatos cálcicos particulados usados puede variar en un amplio intervalo y, generalmente, el diámetro medio ponderado es de 40 micrómetros o menos.

Uno de los inconvenientes de los carbonatos cálcicos particulados como agentes limpiadores abrasivos es que, a pesar de tener una buena acción limpiadora sobre los dientes, pueden resultar más bien abrasivos y dañar el esmalte y la dentina de los dientes más que otros agentes limpiadores abrasivos, tales como el fosfato dicálcico y el metafosfato sódico insoluble. También se sabe que esta abrasividad de los carbonatos cálcicos particulados aumenta con el aumento del peso de los tamaños medios ponderados de partícula, razón por la que se usan generalmente tamaños medios ponderados de partícula bajos, en el intervalo de 1-15 micrómetros.

Ahora se ha encontrado, sorprendente e inesperadamente, que la inclusión de una pequeña cantidad de carbonatos cálcicos particulados más gruesos en los carbonatos cálcicos particulados con un tamaño de partícula medio ponderado, de 15 micrómetros o menos, reduce la abrasividad de éste último a la vez que mantiene la misma eficacia limpiadora. Así, se ha encontrado que una mezcla del 75-92,5% en peso de carbonatos cálcicos particulados con un tamaño de partícula medio ponderado de 15 micrómetros o menos (denominados en lo sucesivo "carbonatos cálcicos finos"), y del 25-7,5% en peso de carbonatos cálcicos particulados con un tamaño de partícula medio ponderado de 30 micrómetros o más (denominados en lo sucesivo "carbonatos cálcicos gruesos") produce la misma eficacia limpiadora pero reduce la abrasividad en comparación con un 100% de los carbonatos cálcicos particulados con un tamaño de partícula medio ponderado de 15 micrómetros o menos.

Los carbonatos cálcicos gruesos tienen un tamaño de partícula medio ponderado en el intervalo de 30 micrómetros a 120 micrómetros, preferiblemente de 50 a 100 micrómetros, y particularmente preferiblemente de 70 a 90 micrómetros. El nivel de carbonatos cálcicos gruesos en la mezcla total de carbonato cálcico particulado es de 7,5-25% en peso, preferiblemente de 10-20% en peso, y particularmente preferiblemente de 12,5-17,5% en peso de la mezcla.

Los carbonatos cálcicos finos tienen un tamaño de partícula medio ponderado de entre 1 y 15 micrómetros, preferiblemente 2-10 micrómetros. La cantidad total de carbonatos cálcicos finos y gruesos usados como agentes limpiadores abrasivos en la pasta de dientes de la invención varía de 25 a 60% en peso de la pasta de dientes, preferiblemente de 35 a 50% en peso.

Los carbonatos cálcicos particulados finos y gruesos pueden ser cada uno de origen natural o sintético. La mezcla de los carbonatos cálcicos particulados finos y gruesos puede obtenerse simplemente mezclando las cantidades adecuadas de los respectivos materiales; cuando son del mismo origen, también es posible dividir una fuente de los carbonatos cálcicos particulados en dos fracciones con el tamaño de partícula medio ponderado requerido, y posteriormente mezclar las dos fracciones en las proporciones requeridas. Los materiales finos y gruesos pueden, por supuesto, añadirse a la pasta de dientes por separado durante la elaboración de ésta última.

Los tamaños de partícula se miden usando un Malvern Mastersizer modelo X versión 1.2a, usando el procedimiento de medida descrito en el manual de instrucciones y usando una lente de 300 mm en el sistema detector. Cuando en la presente memoria descriptiva se hace referencia al D_{50}, significa el tamaño de partícula respecto al que el 50% en peso de la cantidad total de partículas es mayor que él, y el 50% en peso de la cantidad total de partículas es menor que él.

La pasta de dientes de la presente invención comprende un medio líquido o pastoso que puede comprender adicionalmente ingredientes opcionales convencionales, tales como vehículos farmacéuticamente aceptables, tales como almidón, sacarosa, agua o sistemas agua/alcohol, etc.. También pueden incluirse pequeñas cantidades de tensioactivos, tales como tensioactivos aniónicos, no iónicos, catiónicos y anfóteros. Cuando se formula para un dentífrico, dicha formulación puede contener todos los ingredientes habituales de un dentífrico.

Así, puede comprender materiales abrasivos particulados adicionales, tales como sílices, alúminas, fosfatos dicálcicos, pirofosfatos cálcicos, hidroxiapatitos, trimetafosfatos, hexametafosfatos insolubles y similares, incluyendo materiales abrasivos particulados aglomerados, en cantidades menores a las cantidades de carbonato cálcico, no siendo la cantidad total de material abrasivo superior al 60% en peso de la composición.

Adicionalmente, la pasta de dientes puede comprender humectantes, tales como glicerol, sorbitol, propilenglicol, xilitol, lactitol y similares.

También pueden incluirse ligantes y espesantes, tales como carboximetilcelulosa, goma xantana, goma arábiga, sílices espesantes, etc.

También pueden incluirse aromas tales como aceites de menta piperita y de menta spicata, así como conservantes, agentes opacificantes, agentes colorantes, agentes reguladores del pH, agentes edulcorantes, agentes blanqueantes de los dientes, agentes decolorantes peroxi y similares. También pueden incluirse provechosamente agentes estabilizantes de los agentes decolorantes peroxi, tales como ácido dipicolínico o estannato sódico. Adicionalmente, pueden incluirse poliacrilatos completamente neutralizados para mejorar la compatibilidad de los carbonatos cálcicos con los compuestos de flúor.

También pueden incluirse agentes antibacterianos, tales como triclosan, clorhexidina, sales de cobre, cinc y estaño, tales como citrato de cinc, citrato sódico de cinc y pirofosfato de estaño, extracto de sanguinaria y metronidazol. Algunos ejemplos adicionales de agentes antibacterianos son los compuestos de amonio cuaternario, tales como cloruro de cetilpiridinio; las bisguanidas, tales como digluconato de clorhexidina, hexetidina, octenidina, alexidina; los compuestos bifenólicos halogenados, tales como 2,2'-metilen-bis-(4-cloro-6- bromofenol).

También pueden incluirse compuestos poliméricos que puedan incrementar la liberación de los principios activos, tales como agentes antibacterianos. Algunos ejemplos de dichos polímeros son los copolímeros de polivinilmetileter con anhídrido maleico, y otros polímeros incrementadores de la liberación similares, por ejemplo, los descritos en el documento DE-A-3.942.643 (Colgate).

Adicionalmente, también pueden incluirse agentes antiinflamatorios, tales como ibuprofeno, flurbiprofeno, ácido acetilsalicílico, indometacina, etc.

También pueden incluirse agentes anticaries, tales como fluoruro sódico, monofluorfosfato sódico, fluoruro de estaño, aminofluoruros, tampones de la placa, tales como urea, lactato cálcico, glicerofosfato cálcico y poliacrilatos de estroncio. Otros ingredientes opcionales incluyen vitaminas, tales como vitamina C, y extractos de plantas. También pueden incluirse agentes desensibilizantes, tales como monooleato de glicerilo, citrato potásico, cloruro potásico, tartrato potásico, bicarbonato potásico, oxalato potásico, nitrato potásico, así como sales de estroncio.

También pueden incluirse tampones y sales para tamponar el pH y la fuerza iónica de la pasta de dientes, tales como ortofosfato mono o trisódico. También pueden incluirse liposomas y otros encapsulados para mejorar la liberación o la estabilidad de los principios activos.

Adicionalmente, la pasta de dientes puede comprender agentes antisarro, tales como pirofosfatos de metales alcalinos, polímeros que contienen hipofosfito, fosfonatos orgánicos, fosfocitratos, etc.

Además, la pasta de dientes puede comprender biomoléculas funcionales, tales como bacteriocinas, anticuerpos, enzimas y similares.

Otros ingredientes opcionales que pueden incluirse son, por ejemplo, agentes decolorantes, por ejemplo, los descritos en el documento EP-A-0.545.594, sistemas efervescentes, tales como sistemas bicarbonato sódico/ácido cítrico, sistemas modificadores del color, y similares.

La pasta de dientes de la presente invención puede formularse en una formulación simple, o puede formularse en envases multicompartimentales con diferentes formulaciones, por ejemplo, uno que contenga el carbonato cálcico y los ingredientes compatibles con el mismo, y otro que contenga el resto de los ingredientes.

La presente invención se ilustrará adicionalmente mediante el siguiente Ejemplo.

Ejemplo 1

Se midieron los valores de Abrasión Relativa de la Dentina (ARD) de las siguientes pastas de dientes mediante el método ARD de Grabenstetter y col., descrito en J. Dent. Res. 37 (1958), páginas 1060-1068.

El potencial limpiador de estas pastas se midió mediante el procedimiento del modelo de tinción *in vitro* según describe Stookey en J. Dent. Res. 61(11) (1982), páginas 1236-1239.

Las pastas de dientes tenían las siguientes composiciones:

Composición	A	B	C
Yeso particulado (D_{50} = 8 micrómetros)	35	32,5	30
Yeso particulado (D_{50} = 76 micrómetros)	-	2,5	5
Ortofosfato trisódico	1	1	1
Sílice espesante	2	2	2
Sorbitol (70%)	30	30	30
Carboximetilcelulosa sódica	0,9	0,9	0,9
Laurilsulfato sódico	2,5	2,5	2,5
Dióxido de titanio	0,5	0,5	0,5
Formalina	0,075	0,075	0,075
Sacarina sódica	0,22	0,22	0,22
Aroma	1,1	1,1	1,1
Agua	c.s.	c.s.	c.s.

Se obtuvieron los siguientes resultados:

	A	B	C
Valor de ARD	113	122	86
Entre A y B no hay diferencias significativas; entre A y C hay una diferencia significativa ($p<0,05$).			
% de limpieza (después de 750 usos)	55	65	50
% de limpieza (después de 1500 usos)	55	70	55
Entre A, B y C no hay diferencias significativas.			

Estos resultados muestran una ARD significativamente reducida para el producto C, y el mantenimiento de la eficacia limpiadora de la pasta de dientes de la invención.

REIVINDICACIONES

1. Una pasta de dientes que comprende, en un medio líquido o pastoso, carbonato cálcico particulado como principal agente limpiador abrasivo, **caracterizado** porque el carbonato cálcico particulado comprende una mezcla del 75-92,5% en peso de la mezcla fina de carbonato cálcico particulado con un tamaño de partícula medio ponderado de entre 1 y 15 micrómetros, y el 7,5-25% en peso de la mezcla de carbonato cálcico particulado grueso con un tamaño de partícula medio ponderado de entre 30 y 120 micrómetros.

2. Una pasta de dientes según la reivindicación 1, **caracterizada** porque el carbonato cálcico particulado fino tiene un tamaño de partícula medio ponderado de entre 2 y 10 micrómetros.

3. Una pasta de dientes según la reivindicación 1 ó 2, **caracterizada** porque el carbonato cálcico particulado grueso tiene un tamaño de partícula medio ponderado de entre 50 y 100 micrómetros.

4. Una pasta de dientes según las reivindicaciones 1-3, **caracterizada** porque el carbonato cálcico particulado grueso tiene un tamaño de partícula medio ponderado de entre 70 y 90 micrómetros.

5. Una pasta de dientes según la reivindicación 1-4, **caracterizada** porque contiene 10-20% en peso de la mezcla de carbonato cálcico particulado grueso.

6. Una pasta de dientes según la reivindicación 5, **caracterizada** porque contiene 12,5-17,5% en peso de la mezcla de carbonato cálcico particulado grueso.

7. Una pasta de dientes según las reivindicaciones 1-6, **caracterizada** porque la pasta de dientes comprende de 25 a 60% en peso de la pasta de dientes de la mezcla de carbonato cálcico particulado.

8. Una pasta de dientes según la reivindicación 7, **caracterizada** porque contiene de 35 a 50% en peso de la pasta de dientes de la mezcla de carbonato cálcico particulado.